

Corr WO 96/23479

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表平10-513165

(43) 公表日 平成10年(1998)12月15日

(51) Int.Cl. ⁶	識別記号	F I	
A 6 1 K 31/70	ADW	A 6 1 K 31/70	ADW
// A 6 1 K 7/00		7/00	F
7/06		7/06	
7/32		7/32	
47/26		47/26	Z
審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 56 頁) 最終頁に続く			

(21) 出願番号	特願平8-523268	(71) 出願人	バイヤースドルフ・アクチエンゲゼルシャフト
(86) (22) 出願日	平成8年(1996)2月2日		ドイツ連邦共和国デー-20245ハンブルク・ウンナシュトラセ48
(85) 翻訳文提出日	平成9年(1997)7月30日	(72) 発明者	ビュンガー, ヨアヒム
(86) 国際出願番号	PCT/EP96/00441		ドイツ連邦共和国デー-22459ハンブルク・ニーンドルフアーキルヘンベーク39ベ-
(87) 国際公開番号	WO96/23479	(72) 発明者	シュライバー, イエルク
(87) 国際公開日	平成8年(1996)8月8日		ドイツ連邦共和国デー-20146ハンブルク・アンデアフエルビンドウンスパーン10
(31) 優先権主張番号	1 9 5 0 3 4 2 3. 6	(74) 代理人	弁理士 小田島 平吉
(32) 優先日	1995年2月3日		最終頁に続く
(33) 優先権主張国	ドイツ (DE)		
(81) 指定国	EP (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), JP, US		

(54) 【発明の名称】 抗接着性の有効成分

(57) 【要約】

本発明は、微生物、寄生虫および原生動物に対し向けられる抗接着性の有効成分としての、炭水化物もしくは炭水化物誘導体の群からの1種の化合物もしくは多数の化合物の使用に関係する。

【特許請求の範囲】

1. 微生物、寄生虫および原生動物に対する抗接着性の有効成分としての、炭水化物もしくは炭水化物誘導体から成る群からの1種の化合物もしくは数種の化合物の使用。
2. 微生物、寄生虫および原生動物に対する抗接着性の有効成分としての、炭水化物もしくは炭水化物誘導体から成る群からの1種の化合物もしくは数種の化合物の製剤の構成物としての使用。
3. 微生物、寄生虫および原生動物に対し抗接着作用を有する炭水化物もしくは炭水化物誘導体から成る群からの1種の化合物もしくは数種の化合物の一定量を有する製剤。
4. 炭水化物が糖、置換された糖もしくは糖残基を含有する化合物であることを特徴とする、請求の範囲1-3の製剤および使用。
5. 炭水化物が、単糖、二糖、オリゴ糖、アミノ糖、糖エステル、糖エーテル、糖エトキシル化物、糖リピドもしくは多糖であることを特徴とする、請求の範囲1-3の製剤および使用。
6. それらが局所製剤であることを特徴とする、請求の範囲2もしくは3の製剤。
7. 脱臭剤中の有効成分としての請求の範囲1の有効成分の使用。

【発明の詳細な説明】

抗接着性の有効成分

発明の背景

発明の分野

本発明は炭水化物もしくは炭水化物誘導体の使用、およびこれらの物質を含む製剤に関する。

従来技術

表面上の微生物の数を減らすために、殺菌剤によって表面上のそれらを殺すかもしくは浄化組成物で洗い落とす様式でこうすることが既に知られている。双方の方法は既知の欠点を有する。すなわち、例えば、消毒剤は表面を損傷し得、また、浄化組成物はしばしば十分な作用を有しない。

本発明の目的は、従って、それで表面上の微生物、寄生虫および原生動物の数を低く保つかもしくは低下させる、または微生物、寄生虫および原生動物が表面に接着するのを防止することが可能である穏やかでかつ有効な方法を提供することであった。

本発明は、微生物、寄生虫および原生動物に対する抗接着性の有効成分としての、炭水化物もしくは炭水化物誘導体から成る群からの1種の化合物もしくは数種の化合物の使用に関する。

本発明による有効成分の「抗接着性」および「抗接着作用」という用語は、表面への微生物、寄生虫および原生動物の接着が低減されるかもしくは排除されることを意味する。

本発明はまた、微生物、寄生虫および原生動物に対する抗接着性の有効成分としての炭水化物もしくは炭水化物誘導体から成る群からの1種

の化合物もしくは数種の化合物の、製剤の構成物としての使用にも関する。本発明はまた、微生物、寄生虫および原生動物に対して抗接着性の作用を有する炭水化物もしくは炭水化物誘導体から成る群からの1種の化合物もしくは数種の化合物の内容物を有する製剤にも関する。

本発明による抗接着性の有効成分および製剤は予防的に使用され得、また、微

生物、寄生虫および原生動物のわずかなかつ厄介でない蓄積のみを表面に形成する、もしくは、それらがまた既に接着する微生物、寄生虫および原生動物をその表面からはずしかつ従ってそれらの数を低減させる効果を有する。

挙げられる目的は本発明により達成される。本発明による有効成分は、微生物、寄生虫および原生動物への本発明により挙げられる作用を有し、かつ、挙げられるトラブルおよび疾患の治療に適する。

とりわけ適する炭水化物もしくは、言語的に短縮される「炭水化物誘導体」は、また「炭水化物」という用語に入ると意図されており、糖類および置換された糖類もしくは糖残基を含有する化合物である。糖類は、とりわけ、特定のデオキシの形態もまた包含する。

糖構造を有する以下の有効成分が好ましい：

1. 単糖

とりわけ適する単糖は、例えば、テトロース、ペントース、ヘキソースおよびヘプトースである。ペントースおよびヘキソースが好ましい。環構造はフラノースおよびピラノース、ならびにD-およびL-異性体の双方を包含し、ならびにまた α -および β -アノマーも包含される。デオキシの形態もまた適する。

2. 二糖

とりわけ適する二糖は、例えば、上の単糖の2成分の結合により形成される二糖である。この結合は2個のサブユニット間の α -もしくは β -グリコシド結合として存在し得る。ショ糖、マルトースおよびラクトビオースが好ましい。

3. オリゴ糖

とりわけ適するオリゴ糖は、好ましくは1および2で記述された糖の、とりわけ、縮合によりおよび上で挙げられたように形成される既知の結合形態にある2ないし4単位の、数種の、例えば2～7個の糖単位から成り立つ。とりわけ好ましいオリゴ糖は、二糖に加え、三糖である。

4. アミノ糖

アシル化、とりわけアセチル化され得る1個もしくはそれ以上のアミノ基を有する、とりわけ上に記述されたような単糖、二糖およびオリゴ糖がとりわけ適す

る。リボシルアミン、N-アセチルグルコサミンおよびN-ガラクトシルアミンが好ましい。

有機酸もしくは無機酸の糖エステル例えばリン酸糖エステル、カルボン酸との糖エステルもしくは硫酸化糖、とりわけ上に記述された糖のエステルが、さらに有利に使用される。

5. 好ましいリン酸の糖エステルはグルコース1-リン酸、フルクトース1-リン酸、グルコース6-リン酸もしくはマンノース6-リン酸である。

6. 糖類とカルボン酸の好ましいエステルは、例えば、鎖長 C_1 ないし C_{24} のカルボン酸で得られ、例えばセテアリルグルコシド (セピック (Seppic) ; モンタノール (Montanol) 68) ; カプリリル/カプリルグルコシド (セピック (Seppic) ; オラミックス (Oramix) CG-110) ; デシ

ルグルコシド (セピック (Seppic) ; オラミックス (Oramix) NS-10) 、しかしとりわけまた、好ましくは上の糖類の糖酢酸塩である。

7. 糖類、とりわけ上の糖類の鎖長 C_1 ないし C_{24} のアルコールとの糖エーテルもまた好まれ、例えばプラントレン [Plantaren] (商標) 1200 (ヘンケル (Henkel)) もしくはプラントレン [Plantaren] (商標) 2000 (ヘンケル (Henkel)) である。

8. 例えば好ましくは上の糖類を含む、エチレンオキシドおよび/もしくはプロピレンオキシドとの糖類の反応生成物がさらに適する。1ないし40エーテル単位のエ/オ度が適する。

9. 糖脂質

好ましい糖脂質はグリコスフィンゴリピド、とりわけセラミド、セラブロシド、ガングリオシドおよびスルファチドである。

10. 多糖 (天然のおよび合成の起源)

多糖は非分枝状もしくは分枝状であり得、かつ、各場合にとりわけ1ないし7で記述されたような糖類を含むホモ多糖およびヘテロ多糖の双方が適する。好ましい多糖は、デンプン、グリコーゲン、セルロース、デキストラン、ツニシン、イヌリン、キチンおよびとりわけキトサン、アルギン酸およびアルギン酸塩、植

物ガム、体粘液、ペクチン、マンナン、ガラクトン、キシラン、アラバン、ポリオース、コンドロイチン硫酸塩、ヘパリン、ヒアルロン酸ならびにグリコサミノグリカン、ヘミセルロース、置換されたセルロースおよび置換されたデンプン、とりわけ各場合でヒドロキシアシル置換された多糖である。

アミロース、アミロペクチン、キサンタンならびに α -、 β -および γ -デキストリンがとりわけ適する。

多糖は例えば4ないし1,000,000、とりわけ10ないし100,000の単糖から成り立ち得る。有効成分が特定の製剤中で可溶であるもしくはその中に組み込まれ得ることを確実にする鎖長は、好ましくは各場合で選ばれる。

本発明による有効成分は個別的に採用され得る。しかしながら、2種、3種もしくはまたそれ以上の有効成分を一緒に使用することもまた可能である。

とりわけ、単糖およびオリゴ糖が組み合わせられ得、各場合に1種のサッカリドあるいは2種もしくは3種またはそれ以上の糖類を選ぶことが可能である。1種の多糖もしくはまた数種の多糖は、有利には、上述の糖類もしくはそれらの組み合わせと一緒に使用され得る。

フコースがとりわけ好ましい。

以下の組み合わせおよびこれらを含む製剤ならびにそれらの使用が好ましい。

アルドペントースおよびケトペントースならびに

アルドヘキソースおよびケトヘキソースならびに

アルドヘプトースおよびケトヘプトース

から成る群から選ばれる最低3種の有効成分を有する有効成分の組み合わせが好ましい。

挙げられた糖類はまた、とりわけそれらのデオキシの形態で、また、とりわけ本発明による誘導体の形態でもまた存在し得る。これはまた以下の好ましい組み合わせにも適用される。

組み合わせ、とりわけ、各場合に本発明による誘導体の形態でもしくはまたデオキシの形態でも存在することもまた可能である最低1種のデ

オキシ糖もしくは最低1種のデオキシ糖誘導体または最低1種の二糖もしくは最低1種の三糖、を含む最低3種の有効成分の組み合わせがとりわけ好ましい。

組み合わせ、とりわけ、各場合に本発明による誘導体の形態で存在することもまた可能であるフコースを含む最低3種の有効成分の組み合わせがさらに好ましい。

以下の有効成分の組み合わせ a) ~ f) がとりわけ好ましい：

- a) フコース、
ラフィノースおよび
ガラクトース
- b) グルコース 6-リン酸、
マンノース 6-リン酸および
マンノース
- c) ラフィノース、
N-アセチルグルコサミンおよび
フコース
- d) マンノース、
ラムノースおよび
フコース
- e) ガラクトース、
N-アセチルグルコサミンおよび
フコース
- f) マンノース、
ラフィノースおよび

ガラクトース。

当該組み合わせ、および、各場合での三物質の組み合わせ剤の3種の有効成分、各場合に2成分で形成されることになる二物質の組み合わせの特定の個々の成分もまた好ましい。

糖リン酸ならびに／もしくはアミノ糖およびアセチルアミノ糖から成る群から

の1種もしくはそれ以上の糖もまた、有利には、各場合に単糖および／もしくはオリゴ糖から成る群からの1種の糖類もしくは数種の糖類と組み合わせられ得る。

有効成分は、例えば同じ重量をもつ、もしくはまた例えば各場合に別の成分もしくは数種の他の成分に基づき1:100ないし100:1、好ましくは1:10ないし10:1の重量比の組み合わせで使用され得る。

製剤、とりわけ局所製剤例えば本発明による有効成分を有する化粧用および皮膚科用の製剤は、各場合に当該製剤の総重量に基づきこれらを例えば0.01ないし99重量%、好ましくは1ないし50重量%、しかしとりわけ5ないし20重量%の量で含み得る。とりわけ、これらの量はまた各場合にこの組み合わせの個々の成分にも適用される。

驚くことに、本発明による有効成分およびそれらを含む製剤が、接着、すなわち、表面上の微生物、寄生虫および原生動物の通例の数が低減されるように、もしくはまた微生物、寄生虫および原生動物の本質的な量があつたとしてもはや検出されないように、それらがそうした表面に接着する能力を低減することが見出されている。

そうした表面は例えば器官の外表面もしくは器官、とりわけ皮膚もしくは粘膜および体腔もしくは器官の凹窩、傷窩もしくは眼、または眼窩、角膜の表面、ならびに眼球と眼瞼との間の領域である。

健康な温血生物体、とりわけ健康なヒトの皮膚は多数の非病原性微生物が棲息する。皮膚のこのいわゆる細菌叢は無害であるだけでなく、それは日和見のもしくは病原性の微生物に対する防御のための重要な保護を代表する。

細菌は原核生物の単細胞生物体に属する。それらはそれらの形（球形、桿形、らせん形）によりおよび細胞壁の表面（グラム陽性、グラム陰性）によりおおまかに区別され得る。より細かな亜分類はまたその生物体の生理学も考慮に入れる。好気性、嫌気性および任意に嫌気性の細菌がかように存在する。若干の個体は病原性微生物としてのそれらの特性で医学的に重要であり、また他は同様に完全に無害である。

細菌に対し活性である物質はかなりの長期間知られている。例えば抗微生物的に活性な全ての物質に適用され得ない「抗生物質」という用語は1941年に遡り得るが、とは言えペニシリンに関する最初の知見は既に1929年に獲得された。現在の意味での抗生物質は全ての医薬の応用に適さず、また、化粧品の応用には全く適さない。なぜなら温血生物体、すなわち例えば病気の患者はまた、これらが使用される場合にそれらの代謝機能をしばしば幾分損なうからである。

本発明のひとつの目的は、かように、この方向で従来技術を質を高めること、従って、とりわけ、その物質の使用に関連する使用者の健康に許容できない障害なしにグラム陽性および／もしくはグラム陰性の細菌に対して活性である物質を提供することであった。

グラム陰性の微生物は例えば大腸菌エシェリキア コリ (*Escherichia coli*)、シュードモナス属 (*Pseudomonas*) の種および例えばシトロバクター属 (*Citrobacter*) のような腸内細菌科 (*Enterobacteriaceae*) である。

グラム陽性の微生物はまた、化粧品および皮膚科学でも役割を演じる。不潔な皮膚の場合、例えば細菌性の二次感染は、他の影響に加えて病因学的に重要である。不潔な皮膚に関する最も重要な微生物のひとつは座瘡プロピオンバクテリウム プロピオニバクテリウム アクネス (*Propionibacterium acnes*) である。

不潔な皮膚および／もしくは面皰は、軽度の場合でさえ、冒された人の満足のいく状態を損なう。実際には全ての青年がある程度不潔な皮膚により影響されるため、多くの人でこれらの状態を改善する必要性が存在する。

本発明の具体的な目的は、かように不潔な皮膚もしくは座瘡プロピオンバクテリウム プロピオニバクテリウム アクネス (*Propionibacterium acnes*) に対する活性物質もしくは物質の組み合わせを発見することであった。

別の態様では、本発明は化粧用脱臭剤に関する。そうした製剤は体臭を除去するのに役立つ。体臭は、それ自身では無臭である新しい発汗がとりわけグラム陽性の微生物により分解される場合に顕出する。通例の化粧用脱臭剤は多様な作用の有効成分に基づく。

例えばエアゾルスプレー、ロールオンなどの液体の脱臭剤、および例えばデオ

スティック、パウダー、パウダースプレー、直接のクレンジング組成物などの固体の製剤の双方は既知でありかつ通例である。

いわゆる発汗抑制剤では、発汗の形成は収斂剤、主として塩酸アルミニウム（塩化水素アルミニウム）のようなアルミニウム塩により抑制され得る。皮膚タンパク質の変性を別にして、このために使用される物質は、しかしながら、投薬量に依存して腋窩領域の熱バランスに劇的に介

入し、そしてせいぜい例外的な場合に使用されるべきである。

皮膚上の細菌叢は化粧用脱臭剤中に抗微生物物質を使用することにより低減されうる。理想的な場合には、臭いを引き起こす微生物のみが効果的に低減されるべきである。実際は、しかしながら、皮膚上の細菌叢全体が損なわれうるが見出されている。

発汗それ自身の流れは結果として影響されず、また、理想的な場合には、発汗の微生物性分解のみが一時的に停止される。

1種のかつ同じ組成物中に抗微生物作用を有する物質をもつ収斂剤の組み合わせ剤もまた通例である。しかしながら、有効成分の2分類の欠点はこの経路により完全には排除され得ない。

最後に、体臭はまた芳香剤すなわち消費者の美的要求に最低限合致する方法によっても遮蔽され得る。なぜなら、体臭と香水の芳香の混合物はむしろ不快な臭いがするからである。

言うまでもなく、ほとんどの化粧用脱臭剤、およびまたほとんどの化粧品全体は、それらが脱臭する有効成分を含む場合でさえ、香りづけされる。香りづけはまた、化粧用製品の消費者の許容を増大させるもしくは製品にある素質を与えるのにも役立つ。

しかしながら、有効成分を含有する化粧用組成物、とりわけ化粧用脱臭剤の香りづけはまれに問題があるのではない。なぜなら、有効成分および芳香構成物は場合によっては相互に反応し得かつ相互に不活性とし得るからである。

脱臭剤は以下の条件に合致すべきである：

- 1) それらは確実な脱臭を引き起こすべきである。

- 2) 皮膚の本来の生物学的過程が脱臭剤により損なわれてはならない。
- 3) 脱臭剤は過量もしくは意図されるようでない他の使用の場合に無害でなくてはならない。
- 4) それらは反復された使用後に皮膚上で濃縮されたようになるべきでない。
- 5) それらは通例の化粧用製剤に組み込むのが容易であるべきである。

本発明の別の目的は、かように、従来技術の欠点を有しない化粧用脱臭剤を開発することであつた。とりわけ、当該脱臭剤は、皮膚の細菌叢を十分に保護すべきであるが、しかし体臭の原因である微生物の数を選択的に低減させるべきである。

良好な皮膚忍容性により区別される化粧用脱臭剤を開発することがさらに本発明のひとつの目的であつた。いかなる環境下でも脱臭する有効成分は皮膚上で濃縮されたようになるべきでない。

別の目的は、可能な最大の数の通例の化粧用補助物質およびとりわけ脱臭するもしくは抗発汗の作用を有する製剤でまさに重要である香料構成物をもつ添加物と調和する化粧用脱臭剤を開発することであつた。

本発明のさらに別の目的は、それらの作用が顕著に静まることなくより長い時間、およびとりわけ最低半日の位数の期間にわたり活性である化粧用脱臭剤を提供することであつた。

最後に、本発明のひとつの目的は、1種もしくは数種の特定の代表例の形態に限られることなく、化粧用脱臭剤の最も多様な体裁の形態に可能な限り普遍的に組み込まれ得る脱臭する化粧用有効成分を開発することであつた。

細菌と対照的に、ミコタ (Mycota) (Μυκητο = ギリシャ語で真菌) もしくは菌類緑顆体 (mycobionts) ともまた呼ばれる真菌 (fungus = ラテ

ン語) は真核生物に属する。真核生物は、その細胞 (真核細胞) が、いわゆる原核生物 (原核細胞) のものと対照的に、核殻および核膜により細胞質の残部から一線を画される細胞核を有する生物体である。細胞核は染色体に貯蔵される遺伝子的情報を含む。

菌類緑顆体の代表は、例えば酵母（プロトアスコミケス類(Protoascomycetes)）、糸状菌（不整子囊菌類(Plectomycetes)）、ウドンコ病菌（核菌類(Pyrenomycetes)）、露菌（藻菌類(Phycomycetes)）およびトードストゥール（担子菌類(Basidiomycetes)）を包含する。

担子菌類(Basidiomycetes)が包含する真菌は植物生物体ではないが、しかしこれらのように細胞壁、細胞液で満たされた液胞および顕微鏡下に容易に目に見える原形質流動を有する。それらは光合成色素を含有せずかつ炭素従属栄養性である。それらは好氣的条件下で増殖しかつ有機物質の酸化によりエネルギーを得る。いくつかの代表物例えば酵母は、しかしながら、任意の嫌気性生物体でありかつ醗酵過程によりエネルギーを得ることが可能である。

皮膚真菌症はあるタイプの真菌とりわけ皮膚真菌類が皮膚および毛髪の濾胞内に浸透する疾患である。皮膚真菌症の症状は例えば小さな疱疹、落屑、亀裂およびびらんであり、通常かゆみもしくはアレルギー性の湿疹を伴う。

皮膚真菌症は本質的に以下の4群に分類され得る。すなわち、皮膚糸状菌症（例えば表皮糸状菌症、黄癬、微孢子虫症および白癬症）、酵母真菌症（例えばひ癬疹およびピチロスポルム属(Pityrosporum)により引き起こされる他の真菌症、カンジダ感染症、プラストミセス症、ブッセ・ブシュケ病、酵母菌症、白色砂毛症、トルロプシス症および砂毛症）、

糸状菌真菌症（例えばアスペルギルス症、セファロスポリウム症、フィコミコーシスおよびスコブラリオプシス症）ならびに全身性真菌症（例えばクロモミコーシス、コクシジオイデス真菌症およびヒストプラズマ症）。

病原性かつ任意に病原性の微生物は、例えば、酵母、カンジダ属(Candida)の種（例えば鶯口瘡カンジダ カンジダ アルビカンス(Candida albicans)）の群およびピチロスポルム属(Pityrosporum)のファミリーのものからを包含する。ピチロスポルム属(Pityrosporum)の種、とりわけピチロスポルム オーバーレ(Pityrosporum ovale)は、癬風、油性脂漏症および乾性脂漏症の形態の脂漏症のような皮膚疾患の原因であることを保つ(held)はずである。これらの疾患はそれ自身とりわけ頭部脂漏症（＝ふけ症）、脂漏様湿疹およびピチロスポルム毛嚢炎として

現われる。乾癬の発症におけるピチロスポルム オバーレ(*Pityrosporum ovale*)の寄与は専門家により議論されている。

ヒトの皮膚の全領域が皮膚真菌症により冒され得る。皮膚糸状菌症はほとんどもっぱら皮膚、毛髪および爪を冒す。酵母真菌症は粘膜および内部器官もまた冒すが、一方全身性真菌症は通常器官系全体に広がる。

衣服、装身具もしくは靴のために水分および熱が蓄積し得る身体の領域がとりわけしばしば冒される。水虫はかように最もよく知られかつ最も広まった皮膚真菌症の1種である。指の爪および足指の爪の領域の真菌の疾患(爪甲真菌症)はさらにとりわけ不快である。

真菌および細菌による皮膚の重複感染もまたまれではない。

1種もしくはそれ以上のしばしば生理的な病原体例えばブドウ状球菌、しかししばしばまた非生理学的病原体例えば驚口瘡カンジダ カンジダ

アルビカンス(*Candida albicans*)の多い微生物数をもつ新規の感染は、存在する一次感染すなわち皮膚の正常な細菌集団とともに存在し、かつ、悪影響が同時に起こる場合は、冒された皮膚の「重複感染」が起こりうる。皮膚(もしくは他の身体器官)の正常な細菌叢は、ここでは二次的病原体によりほとんど完全に一面にはびこるようになる。

有利に進行する場合には、そうした重複感染は問題の微生物に依存して不快な皮膚症状(かゆみ、美しくない外側外観)にそれら自身を表し得る。不都合に進行する場合には、しかしながら、それらは広い範囲にわたる皮膚の破壊につながり得、そして最悪の場合にはついに患者の死亡にさえなり得る。

上に記述されたタイプの重複感染は、例えばA I D Sの完全な病像でしばしば存在する二次的疾患である。低い微生物密度でいずれにしてもそれ自身無害であるがしかしある環境下ではまた決定的に病原性でもある微生物が、この様式で健康な皮膚微生物叢の一面に生える。言うまでもなく、A I D Sの症例では他の身体器官もまた重複感染により冒される。

そうした重複感染はまた、多数の皮膚科疾患例えばアトピー性湿疹、神経皮膚炎、座瘡、脂漏性皮膚炎もしくは乾癬でも観察される。多くの医学的および治療

的手段例えば腫瘍性疾患の放射線療法もしくは化学療法、薬物により誘発されたおよび副作用として引き起こされた免疫抑制、または全身性の抗生物質治療、ならびに外部の化学的もしくは物理的影響（例えば環境汚染、スモッグ）もまた、外部および内部の器官、とりわけ皮膚および粘膜の重複感染の発生を促進する。

個々の場合に抗生物質で重複感染と戦うことが容易に可能であるとは

言え、そうした物質は通常不快な副作用という欠点を有する。例えば、患者はしばしばペニシリンにアレルギー性であり、そしてこの理由のために対応する治療がそうした症例で問題外となろう。

局所的に投与される抗生物質はさらに、それらが皮膚微生物叢を二次的な病原体から解放しないのみならずそれ自身生理学的である皮膚微生物叢を重篤に障害するという欠点を有し、かつ、自然の治癒過程はここでもこの方法で遅らせられる。

本発明の目的は、従来技術の欠点を排除すること、および、生理学的皮膚微生物叢が顕著な損失を被らずに、その使用により重複感染が治癒され得る物質およびそうした物質を含む製剤を提供することであった。

原生動物は、無性的に（2個もしくは4個の分裂および出芽により）ならびにまた性的に（配偶子接合、ガモントガミーおよび自家生殖）繁殖する、はっきりと一線を画された細胞核をもつ寄生性に生存する単細胞生物体である。環境からの食物の取り込みは浸透により、および飲作用もしくは食作用による。生長性の、通常は運動性状態（いわゆる栄養型個体）に加え、不都合な環境下ではほとんどの原生動物は永久形態として嚢子もまた形成し得る。

原生動物はそれらの運動に関する方法および器官により4個の異なる群に分類される。すなわち

- (a) 鞭毛虫亜門(Mastigophra) (鞭毛で匍匐する)
- (b) 肉質虫亜門(Sarcodina)／根足虫上綱(Rhizopodea) (原形質突起によるアメーバ様運動パターン)
- (c) 孢子虫綱(Sporozoea) (蛇状のもしくは滑走する運動パターン)
- (d) 繊毛虫類(Cililata)／繊毛虫門(Ciliophora) (繊毛もしくは鞭毛)。

亜熱帯および熱帯の地域では、寄生性に生存する原生動物はしばしば咬むおよび吸う昆虫により、しかしまたほこりおよび汚れの感染および食物連鎖によっても伝播される。

いくつかの医学的および皮膚科学的に関連する原虫症は、トリコモナス症（腔トリコモナス トリコモナス ヴァジナリス(*Trichomonas vaginalis*)により引き起こされる）、ランブル虫赤痢（ランブル鞭毛虫ランブリア インテスチナリス(*Lamblia intestinalis*)により引き起こされる）、内臓のならびに皮膚のおよび粘膜のリーシュマニア症（例えばドノヴァンリーシュマニア レイシュマニア ドノヴァニイ(*Leishmania donovani*)、熱帯リーシュマニア *L. tropica*）、ブラジルリーシュマニア *L. brasiliensis*）、メキシコリーシュマニア *L. mexicana*）、*L. diffusa*）もしくはピファノリーシュマニア *L. pifanoi*により引き起こされる）、トリパノソーマ症（多様なトリパノソーマ属(*Tripanosoma*)の種により引き起こされる）、アメーバ赤痢およびアメーバ症（例えば多様なエントアメーバ属(*Entamoeba*)の種、ヨードアメーバ イオダメーバ ブトスクリイ(*Iodamoeba butschlii*)もしくはネグレリア フォウレリ(*Naegleria fowleri*)により引き起こされる）、コクシジウム症（イソスポラ ベリ(*Isospora belli*)による）およびバランチジウム赤痢（大腸バランチジウム バランチジウム コリ(*Balantidium coli*)により引き起こされる）である。

原虫症により引き起こされる医学的および皮膚科学的な現象は、ヒトの満足のいく状態をとときにはかなり損なう。従って、冒されたヒトでのこの状態を改善する大きな必要が存在する。本発明のひとつの目的は、

かように、原生動物に対して有効な有効成分を発見することであった。

寄生虫は、自分を犠牲にして他の生物体上で（＝外部寄生体）もしくは内で（＝内部寄生体）生き、そしてとりわけ引き起こされる疾患症状をもつ（＝病原性寄生虫）もしくはもたない（非病原性寄生虫）、単細胞もしくは多細胞の植物もしくは動物である。生態は、おそらく周期的、一時的もしくは普遍の寄生虫としてのみ、*aprophytic*かもしくは純粹に寄生性かのいずれかである。寄生虫の成長

は1種もしくはそれ以上の異なる宿主生物体に結びつけられ、また、ヒトは中間宿主もしくは最終宿主であり得る。

医学的および皮膚科学的に重要な寄生虫は例えば蠕虫であり、これは順に、吸虫綱(Trematoda)、条虫綱(Cestoda)および線形動物門(Nematoda)に亜分類される。ヒトの満足な状態を損なう蠕虫症は、例えばビルハルツ住血吸虫症(住血吸虫属(*Schistosoma*)の種により引き起こされる)、小腸および他の内部器官の条虫の外寄生症(例えばテニア属(*Taenia*)の種およびエキノコックス属(*Echinococcus*)の種により引き起こされる)、回虫症(回虫 アスカリス ルンブリコイデス(*Ascaris lumbricoides*)により引き起こされる)、蟯虫症(蟯虫 エンテロビウム ヴェルミクларリス(*Enterobium vermicularis*)により引き起こされる)、肺吸虫症(肺吸虫属(*Paragonium*)の種により引き起こされる)、フィラリア症(例えばバンクロフト糸状虫 ブケレリア バンクロフティ(*Wuchereria bancrofti*)により引き起こされる)および他の線虫の外寄生症(例えばヒト鞭虫 トリクリス トリクラ(*Trichuris trichura*)もしくは旋毛虫 トリキネラ スピラリス(*Trichinella spiralis*)により引き起こされる)である。

ヒトおよび動物中に寄生性に生存しかつ宿主生物体に医学的および皮膚科学的变化を引き起こす、多数の昆虫種およびクモがさらに存在する。この点に関してヒトの満足の行く状態を損なう原因である寄生虫症は、例えば、先端皮膚炎(穀類ダニ、例えばシラミダニ ペディキュロイデス ヴェントリコスス(*Pediculoides ventricosus*)により引き起こされる)、疥癬(ヒゼンダニ サルコプティス スカベイ(*Sarcoptes scabiei*)により引き起こされる)、ハエおよび／もしくはハエの幼虫の外寄生(例えばツェツェバエ属(*Glossina*)、ストモクシス属(*Stomoxys*)、アブ属(*Tabanus*)、メクラアブ属(*Chrysops*)、キンバエ属(*Lucilia*)、オビキンバエ属(*Chrysomyia*)、コクリオミイヤ属(*Cochliomyia*)、ヴォールファールトニクバエ属(*Wohlfartia*)、コルディオロビア属(*Coldylobia*)もしくはヒフバエ属(*Dermatobia*)の種により引き起こされる)、蚊および／もしくは蚊の幼虫の外寄生(例えばヤブカ属(*Aedes*)、イエカ属(*Culex*)、ハマダラカ属(*Anopheles*)、フレボトムス属(*Phlebotoms*)、キュリコイデス属(*Culicoides*)、スミリウム属(*S*

umilium)もしくはヘマゴゲス属(*Haemagoges*)の種により引き起こされる)、ダニの外寄生(例えばナガヒメダニ アルガス ペルシクス(*Argas persicus*)および他のナガヒメダニ属(*Argas*)の種、オルニトドロス エラチクス(*Ornithodoros erraticus*)および他のカズキダニ属(*Ornithodoros*)の種ならびにオロビウス属(*Orobia*)、コイタマダニ属(*Rhipicephalus*)、カクマダニ属(*Dermacentor*)、チマダニ属(*Haemaphysalis*)、キララマダニ属(*Amblyomma*)およびマダニ属(*Ixodes*)の種により引き起こされる)、ポロセファルス属(*Porocephalus*)の一種による感染(ポロセファルス属(*Porocephalus*)の種により引き起こされる)、ノミの外寄生(例えばヒトノミ プレッ

クス イリタンス(*Pulex irritans*)、イヌノミ クテノセファリデス カニス(*Ctenocephalides canis*)、インドネズミノミ ゼノプシラ ケオピス(*Xenopsylla cheopis*)、ヨーロッパネズミノミ ノソプシルス ファシアツス(*Nosopsyllus fasciatus*)もしくはスナノミ サルコプシラ ペネトランス(*Sarcopsylla penetrans*)により引き起こされる)、シラミの外寄生(例えば、ケジラミ プチルス プビス(*Pthirus pubis*)、ヒトジラミ ペディキュルス フマンス(*Pediculus humans*)もしくはペディキュルス キャピティス(*Pediculus capitis*)により引き起こされる)、ナンキンムシの外寄生(例えばトコジラミ シメクス レクチュラリウス(*Cimex lectularius*)、シメクス ヘミプテルス(*Cimex hemipterus*)、パンストロンギルス メギスツス(*Panstrongylus megistus*)、ロドニウス プロリクス(*Rhodnius prolixus*)、トリアトーマ ディミジアータ(*Triatoma dimidiata*)、トリアトーマ インフェスタンス(*Triatoma infestans*)、トリアトーマ ソルジダ(*Triatoma sordida*)もしくはトリアトーマ ブラジリエンシス(*Triatoma brasiliensis*)により引き起こされる)、ならびにダニの外寄生(例えばニキビダニ デモデクス フォリキュロルム(*Demodex folliculorum*)および他のニキビダニ属(*Demodex*)の種により、ならびにニワトリダニ属(*Dermanyssus*)の種、グリシファグス ドメスティクス(*Glyciphagus domesticus*)、シラミダニ属(*Ptyompterus*)の種、ヒゼンダニ属(*Sarcoptes*)の種もしくはツツガムシ属(*Trombicula*)の種により引き起こされる)である。

ヒト生物体上もしくは内で生存する寄生虫が、今度はそれらが再度、宿主生物体例えばヒトの健康および満足のいく状態を持続して損ない得る細菌、ミコタ(Mycota)、原生動物およびウイルスのキャリアーとなり

得ることが、ここで付加的に重要である。従って、寄生虫症に対し有効でありかつ医学的もしくは皮膚科学的な症状を改善することが可能である有効成分を発見する必要が存在した。従ってこの必要に合致することが本発明のさらなる目的であった。

原核生物および真核生物の生物体と対照的に、ウイルス(virus=毒のラテン語)は生合成に宿主細胞を必要とする生物学的構造である。細胞外性ウイルス(「ビリオン」ともまた呼ばれる)は、一本鎖もしくは二本鎖の核酸配列(DNAもしくはRNA)およびおそらく付加的な脂質を含有する殻(エンベロープ)で取り囲まれたタンパク質外被(キャプシドと呼ばれる)から成る。核酸およびキャプシドの全体の構造はまたヌクレオキャプシドとも呼ばれる。ウイルスの分類は、慣習的には臨床的基準によったが、しかし今日では通常それらの構造、それらの形態学により、およびとりわけ核酸配列による。

医学的に重要なウイルスの種類は、例えば、インフルエンザウイルス(オルトミクソウイルス科(Orthomyxoviridae)のファミリー)、リッサウイルス(例えば狂犬病、ラブドウイルスのファミリー)、エンテロウイルス(例えばA型肝炎ウイルス、ピコルナウイルス科(Picornaviridae)のファミリー)およびヘパドナウイルス(例えばB型肝炎ウイルス、ヘパドナウイルス科(Hepadnaviridae)のファミリー)である。

殺ウイルス剤すなわちウイルスを破壊する物質は実際の意味では存在しない。なぜなら、ウイルスはそれら自身の代謝を有しないからである。この理由から、ウイルスは生物体として分類されるべきかどうかともまた議論されている。冒されていない細胞に対する損傷をもたない薬理学的介入はいずれにしても困難である。ウイルスに対する戦いでの可能性の

ある作用メカニズムは、第一に、例えば複製に重要である宿主細胞中に存在する

酵素を阻害することによるそれらの複製の混乱である。宿主細胞内へのウイルス核酸の放出がさらに防止され得る。ここで寄託される開示の文脈において、「抗ウイルス性」もしくは「ウイルスに対し活性」、「殺ウイルス性」などのような用語は、予防的にであろうと治療的にであろうと、個々の場合に物質の実際の作用メカニズムに関係なく、ウイルス感染の有害な結果から単細胞もしくは多細胞の生物体を保護するその物質の特性を意味するとして理解される。

しかしながら、従来技術はウイルスに対し活性でありかつさらに損傷もしくは宿主生物体に対し許容できる程度の損傷を引き起こさない物質の欠損を有する。

本発明のひとつの目的は、かようにこの不十分な現状を改善すること、すなわち、予防的にであろうと治療的にであろうと、ウイルス感染の有害な結果から単細胞もしくは多細胞の生物体を効果的に保護する物質を発見することであった。

上の目的はまた、本発明による有効成分およびそれらで得られる製剤によっても達成される。本発明による有効成分は挙げられる状況および疾患の治療に著しく適する。

全ての微生物、寄生虫および原生動物の表面への接着は、本発明による有効成分およびこれらを含む製剤で低減され得るかもしくは避けられ得る。

これは例えば細菌、ならびにとりわけグラム陽性およびグラム陰性の細菌、酵母、真菌、皮膚糸状菌、ウイルス、ウイロイドおよびプリオンについて事実である。

とりわけ、例えば以下の微生物、寄生虫および原生動物、ならびにそれらにより引き起こされる混乱および疾患は、本発明により、とりわけ良好に、とりわけ局所的に治療され得る。

1. グラム陽性細菌

例として：

任意に病原性のおよび病原性のミクロコッカス科 (Micrococcaceae)、とりわけ例えば腋窩の臭いの発生を伴うおよびアトピー性湿疹を伴う表皮ブドウ球菌 スタフィロコッカス エピデルミディス (Staphylococcus epidermidis)、ならびに例えばアトピー性湿疹を伴うならびに神経皮膚炎および乾癬を伴う重要な病原体と

しての黄色ブドウ球菌 スタフィロコックス アウレウス (*Staphylococcus aureus*)、例えば腋窩の臭いの発生を伴うコリネバクテリウム属 (*Corynebacterium*) の種、例えばニキビの発症を伴うおよび不潔な皮膚を伴うプロピオン酸菌属 (*Propionibacterium*) の種。

2. グラム陰性細菌

例として：

例えば潰瘍性大腸炎を伴う大腸菌 エシェリキア コリ (*Escherichia coli*)、例えば、例えば腹腔内のおよび腓嚢胞性線維症での開いた傷の重複感染を伴う緑膿菌 シュードモナス エルギノサ (*Pseudomonas aeruginosa*)、例えば消化管感染症を伴う腸球菌科 (*Enterococcaceae*)。有効成分は灌注および経口的に使用され得る。

3. 酵母

例として：

例えばふけの原因となるおよび例えば癬風、ピチロスポラム毛囊炎、脂

漏性湿疹、乾癬、皮膚および全身性の真菌症を伴う、A I D S および関連疾患を伴うピチロスポラム オーバーレ (*Pityrosporum ovale*)、例えば皮膚カンジダ症の発症の原因である鵝口瘡カンジダ カンジダ アルビカンス (*Candida albicans*)。有効成分は局所的、非経口的およびまた経口的にも投与され得る。例えば輸液もしくは注入のような血管内投与が好ましい。

4. 真菌

例として：

例えばケカビ真菌症および鵝口瘡の原因であるケカビ属 (*Mucor*) の種、例えば皮膚アルベルギルス症の原因である黒色アスペルギルス アスペルギルス ニガー (*Aspergillus niger*)、ならびに例えばクリプトコックス症を伴うクリプトコックス ネオフォルマンズ (*Cryptococcus neoformans*)。有効成分は「酵母」について記述されるように投与され得る。

5. 皮膚糸状菌

例として：

例えば、皮膚糸状菌症例えば水虫の発症の原因である。有効成分は「酵母」について記述されるように投与され得る。

6. ウイルス

例として：

単純ヘルペスウイルスタイプ1および2、水痘－帯状疱疹ウイルス（帯状ヘルペス）、エプスタイン－バーウイルス（ファイバーの腺熱）、サイトメガロウイルス、疣贅ウイルスおよびパピローマウイルス、ならびにまた他の既知のウイルス。有効成分は「酵母」について記述されるように投与され得る。

原生動物は、無性的に（2個もしくは4個への分裂および出芽により）ならびにまた性的に（配偶子接合、ガモントガミーおよび自家生殖）繁殖する、はっきりと一線を画された細胞核をもつ寄生性に生存する単細胞生物体である。環境からの食物の取り込みは浸透により、および飲作用もしくは食作用による。生長性の、通常は運動性状態（いわゆる栄養型個体）に加え、不都合な環境下ではほとんどの原生動物は永久形態として嚢子もまた形成し得る。

原生動物はそれらの運動に関する方法および器官により4個の異なる群に分類される。すなわち

- (a) 鞭毛虫亜門(Mastigophra) (鞭毛で匍匐する)
- (b) 肉質虫亜門(Sarcodina)／根足虫上綱(Rhizopodea) (原形質突起によるアメーバ様運動パターン)
- (c) 孢子虫綱(Sporozoea) (蛇状のもしくは滑走する運動パターン)
- (d) 繊毛虫類(Cililata)／繊毛虫門(Ciliophora) (繊毛もしくは鞭毛)。

亜熱帯および熱帯の地域では、寄生性に生存する原生動物はしばしば咬むおよび吸う昆虫により、しかしまたほこりおよび汚れの感染および食物連鎖によっても伝播される。

いくつかの医学的および皮膚科学的に関連する原虫症は、トリコモナス症（*膣トリコモナス* トリコモナス ヴァジナリス(*Trichomonas vaginalis*)により引き起こされる）、ランブル虫赤痢（ランブル鞭毛虫ランブリア インテスチナリス(*Lamblia intestinalis*)により引き起こされる）、内臓のならびに皮膚のお

よび粘膜のリーシュマニア症（例えばドノヴァンリーシュマニア レイシュマニア ドノヴァニイ(*Leishmania donovani*)、熱帯リーシュマニア *L. tropica*）、ア

ラジルリーシュマニア *L. brasiliensis*）、メキシコリーシュマニア *L. mexicana*）、*L. diffusa*）もしくはピファノリーシュマニア *L. pifanoi*）により引き起こされる）、トリパノソーマ症（多様なトリパノソーマ属(*Tripanosoma*)の種により引き起こされる）、アメーバ赤痢およびアメーバ症（例えば多様なエントアメーバ属(*Entamoeba*)の種、ヨードアメーバ イオダアメーバ ブトスクリイ(*Iodamoeba butschlii*)もしくはネグレリア フォウレリ(*Naegleria fowleri*)により引き起こされる）、コクシジウム症（イソスポラ ベリ(*Isospora belli*)による）およびバランチジウム赤痢（大腸バランチジウム バランチジウム コリ(*Balantidium coli*)により引き起こされる）である。

原虫症により引き起こされる医学的および皮膚科学的な現象は、ヒトの満足のいく状態をとときにはかなり損なう。従って、冒されたヒトでのこの状態を改善する大きな必要が存在する。本発明のひとつの目的は、かように、原生動物に対して有効な有効成分を発見することであった。

寄生虫は、自分を犠牲にして他の生物体上で（＝外部寄生体）もしくは内で（＝内部寄生体）生き、そしてとりわけ引き起こされる疾患症状をもつ（＝病原性寄生虫）もしくは持たない（非病原性寄生虫）、単細胞もしくは多細胞の植物もしくは動物である。生態、おそらく周期的、一時的もしくは普遍の寄生虫としてのみ、*aprophytic*かもしくは純粹に寄生性のかいずれかである。寄生虫の成長は1種もしくはそれ以上の異なる宿主生物体に結びつけられ、また、ヒトは中間宿主もしくは最終宿主であり得る。

医学的および皮膚科学的に重要な寄生虫は例えば蠕虫であり、これ

は順に、吸虫綱(*Trematoda*)、条虫綱(*Cestoda*)および線形動物門(*Nematoda*)に亜分類される。ヒトの満足の状態を損なう蠕虫症は、例えばビルハルツ住血吸虫症

(住血吸虫属(*Schistosoma*)の種により引き起こされる)、小腸および他の内部器官の条虫の外寄生症(例えばテニア属(*Taenia*)の種およびエキノкокクス属(*Echinococcus*)の種により引き起こされる)、回虫症(回虫 アスカリス ルンブリコイデス(*Ascaris lumbricoides*)により引き起こされる)、蟯虫症(蟯虫 エンテロビウム ヴェルミクラリス(*Enterobium vermicularis*)により引き起こされる)、肺吸虫症(肺吸虫属(*Paragonium*)の種により引き起こされる)、フィラリア症(例えばバンクロフト糸状虫 ブケレリア バンクロフティ(*Wuchereria bancrofti*)により引き起こされる)および他の線虫の外寄生症(例えばヒト鞭虫 トリクリス トリクラ(*Trichuris trichura*)もしくは旋毛虫 トリキネラ スピラリス(*Trichinella spiralis*)により引き起こされる)である。

ヒトおよび動物中に寄生性に生存しかつ宿主生物体に医学的および皮膚科学的变化を引き起こす、多数の昆虫種およびクモがさらに存在する。この点に関してヒトの満足の行く状態を損なう原因である寄生虫症は、例えば、先端皮膚炎(穀類ダニ、例えばシラミダニ ペディキュロイデス ヴェントリコスス(*Pediculoides ventricosus*)により引き起こされる)、疥癬(ヒゼンダニ サルコプティス スカベイ(*Sarcoptes scabiei*)により引き起こされる)、ハエおよび／もしくはハエの幼虫の外寄生(例えばツェツェバエ属(*Glossina*)、ストモクシス属(*Stomoxys*)、アブ属(*Tabanus*)、メクラアブ属(*Chrysops*)、キンバエ属(*Lucilia*)、オビキンバエ属(*Chrysomya*)、コクリオミヤ属(*Cochliomyia*)、ヴォー

ルファールトニクバエ属(*Wohlfartia*)、コルディオロビア属(*Coldylobia*)もしくはヒフバエ属(*Dermatobia*)の種により引き起こされる)、蚊および／もしくは蚊の幼虫の外寄生(例えばヤブカ属(*Aedes*)、イエカ属(*Culex*)、ハマダラカ属(*Anopheles*)、フレボトムス属(*Phlebotoms*)、キュリコイデス属(*Culicoides*)、スミリウム属(*Sumilium*)もしくはヘマゴゲス属(*Haemagoges*)の種により引き起こされる)、ダニの外寄生(例えばナガヒメダニ アルガス ペルシクス(*Argas persicus*)および他のナガヒメダニ属(*Argas*)の種、オルニトドロス エラチクス(*Ornithodoros erraticus*)および他のカズキダニ属(*Ornithodoros*)の種ならびにオロビウス属(*Orobius*)、コイタマダニ属(*Rhipicephalus*)、カクマダニ属(*Dermacentor*

)、チマダニ属(*Haemaphysalis*)、キララマダニ属(*Amblyomma*)およびマダニ属(*Ixodes*)の種により引き起こされる)、ポロセファルス属(*Porocephalus*)の一種による感染(ポロセファルス属(*Porocephalus*)の種により引き起こされる)、ノミの外寄生(例えばヒトノミ プレックス イリタンス(*Pulex irritans*)、イヌノミ クテノセファリデス カニス(*Ctenocephalides canis*)、インドネズミノミ ゼノプシラ ケオピス(*Xenopsylla cheopis*)、ヨーロッパネズミノミノソプシルス ファシアツス(*Nosopsyllus fasciatus*)もしくはスナノミ サルコプシラ ペネトランス(*Sarcopsylla penetrans*)により引き起こされる)、シラミの外寄生(例えば、ケジラミ プチルス プビス(*Phthirus pubis*)、ヒトジラミ ペディキュルス フマンus(*Pediculus humans*)もしくはペディキュルス キャピティス(*Pediculus capitis*)により引き起こされる)、ナンキンムシの外寄生(例えばトコジラミ シメクス レクチュラリウス(*Cimex lectularius*)、シメクス ヘミプテルス(*Cimex hemipt*

erus)、パンストロンギルス メギスツス(*Panstrongylus megistus*)、ロドニウス プロリクス(*Rhodnius prolixus*)、トリアトーマ ディミジアータ(*Triatoma dimidiata*)、トリアトーマ インフェスタンス(*Triatoma infestans*)、トリアトーマ ソルジダ(*Triatoma sordida*)もしくはトリアトーマ ブラジリエンシス(*Triatoma brasiliensis*)により引き起こされる)、ならびにダニの外寄生(例えばニキビダニ デモデクス フォリキュロルム(*Demodex folliculorum*)および他のニキビダニ属(*Demodex*)の種により、ならびにニワトリダニ属(*Dermanyssus*)の種、グリシファグス ドメスティクス(*Glyciphagus domesticus*)、シラミダニ属(*Pyemotes*)の種、ヒゼンダニ属(*Sarcoptes*)の種もしくはツツガムシ属(*Trombicula*)の種により引き起こされる)である。

ヒト生物体上もしくは内で生存する寄生虫が、今度はそれらが再度、宿主生物体例えばヒトの健康および満足のいく状態を持続して損ない得る細菌、ミコタ(*Mycota*)、原生動物およびウイルスのキャリアーとなり得ることが、ここで付加的に重要である。従って、寄生虫症に対し有効でありかつ医学的もしくは皮膚科学的な症状を改善することが可能である有効成分を発見する必要が存在した。従っ

てこの必要に合致することが本発明のさらなる目的であった。この目的は本発明により達成されている。本発明による有効成分および製剤は寄生虫症および原虫症の治療、とりわけ上の混乱および疾患の治療に適する。

有効成分は局所的に、経皮的に、経皮的に、非経口的に、経口的に、でなければ血管内に使用され得る。

本発明による有効成分を含む製剤は、局所的製剤例えば化粧用および皮膚科用の局所的製剤、もしくはまた通例の薬物の体裁の形態であり得

る。脱臭剤もしくは脱臭するボディクレンジング製品またはボディケア製品が好ましい。しかしながら、身体もしくは皮膚の治療のみならず固い表面、医用材料、装置、器具、家具および壁の浄化および消毒も意図される消毒剤および／もしくは浄化組成物もまた当該有効成分を含み得る。

身体に向けられる浄化組成物、消毒剤およびリンス組成物もまた、局所的製剤のように皮膚の治療に使用され得る。しかしながら、それらは好ましくは体腔、傷ならびにまた口腔前庭および咽頭腔ならびに鼻の治療に使用される。

本発明による有効成分は、製薬学的に耐えられる通例の希釈剤もしくは担体と、および適切な場合は他の補助物質と混合され得、かつ、例えば経口的にもしくは非経口的に投与され得る。それらは好ましくは、顆粒、カプセル剤、丸剤、錠剤、フィルムコーティング錠、糖衣錠、シロップ、乳剤、懸濁剤、分散剤、エアゾルおよび溶液、ならびに液体の形態で経口的に、さもなくば坐剤もしくは膣ビーズ剤として、または例えば溶液、乳剤もしくは懸濁剤の形態で非経口的に投与され得る。経口的に投与されることになる調製物は、甘味料、矯味矯臭剤、着色料および保存剤のような1種もしくはそれ以上の添加物を含み得る。錠剤は、製薬学的に耐えられる通例の補助物質例えば炭酸カルシウム、炭酸ナトリウム、乳糖およびタルクのような不活性の希釈剤、顆粒化剤ならびにデンプンもしくはアルギン酸のような経口投与に際し錠剤の崩壊を促進する作用物質、デンプンもしくはゼラチンのような結合剤、ならびにステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸およびタルクのような滑沢剤と混合された有効成分を含み得る。

適する担体は例えば乳糖、ゼラチン、トウモロコシデンプン、ステアリン酸、エタノール、プロピレングリコール、テトラヒドロフルフリルアルコールのエーテルおよび水である。

製剤は、例えば、有効成分を溶媒および／もしくは担体で、適する場合は乳化剤および／もしくは分散剤を使用してのばすことにより調製され、また、例えば水が希釈剤として使用される場合は、適切な場合は有機溶媒が補助溶媒として使用され得る。

製剤は通例の様式で、好ましくは経口的にもしくは非経口的に、とりわけ経舌的にもしくは静脈内に投与される。経口の使用の場合は、錠剤はもちろんまた、挙げられた担体に加え、クエン酸ナトリウム、炭酸カルシウムおよびリン酸二カルシウムのような添加物を、デンプン、好ましくはジャガイモデンプン、ゼラチンなどのような多様な付加的物質と一緒に含み得る。ステアリン酸マグネシウム、ラウリル硫酸ナトリウムおよびタルクのような滑沢剤が錠剤作成のためにさらに共使用され得る。口内適用に対し向けられる水性の懸濁剤および／もしくはエリキシル剤の場合は、多様な味改善剤もしくは着色剤が、上述の補助物質に加えて有効成分に添加され得る。

非経口の使用の場合は、有効成分の溶液は適する液体の担体材料を使用して採用され得る。

カプセル剤は唯一の構成物としてもしくは炭酸カルシウム、リン酸カルシウムもしくはカオリンのような固形の希釈剤と混合される有効成分を含有し得る。注入可能な調製物はそれ自身既知の様式で同様に製剤される。

製薬学的調製物は有効成分を0.1ないし90重量%、とりわけ1～90重

量%の量で含み得る。カプセル剤がとりわけ好ましい。個々の用量は好ましくは0.1ないし10gの量で有効成分を含む。

本発明による化粧用および／もしくは皮膚科用の製剤は通例の組成を有し得、かつ、皮膚科の治療もしくはケア用化粧品の状況でのトリートメントの状況で皮膚および／もしくは髪の治療に使用され得る。しかしながら、それらはまた、装飾用化粧品でのメイクアップ製品で、もしくは化粧用および皮膚科用のクレンジ

ング製品でも採用され得る。

使用のためには、本発明による化粧用および／もしくは皮膚科用の製剤は、十分な量で、化粧用および皮膚科用の作用物質に通例の様式で、皮膚および／もしくは髪に適用される。

サンスクリーン組成物の形態にある化粧用および皮膚科用の製剤もまた有利である。これらは、有利には、付加的には、最低1種のUVAフィルターおよび／もしくは最低1種のUVBフィルターならびに／または最低1種の無機色素を含む。

UVAフィルターおよびUVBフィルターもしくは色素の添加はまた、当該製剤の安定化にも適する。

本発明による製剤は、さらに好ましくは、UVB領域のUV輻射を吸収する物質を含み得、フィルター物質の総量は、紫外輻射の全領域から皮膚を保護する化粧用製剤を提供するために、当該製剤の総重量に基づき、例えば0.1重量%ないし30重量%、好ましくは0.5ないし10重量%、とりわけ1ないし6重量%である。それらはまたサンスクリーン組成物としても使用され得る。

このUVBフィルターは脂溶性もしくは水溶性であり得る。挙げられうる脂溶性物質は、例えば：

- ・ 3-ベンジリデンカンファーおよびその誘導体、例えば3-(4-メチルベンジリデン)カンファー、
- ・ 4-アミノ安息香酸誘導体、好ましくは4-(ジメチルアミノ)安息香酸2-エチルヘキシルおよび4-(ジメチルアミノ)安息香酸アミル、
- ・ ケイヒ酸エステル、好ましくは4-メトキシケイヒ酸2-エチルヘキシルおよび4-メトキシケイヒ酸イソペンチル、
- ・ サリチル酸エステル、好ましくはサリチル酸2-エチルヘキシル、サリチル酸4-イソプロピルベンジルおよびサリチル酸ホモメンチル、
- ・ ベンゾフェノン誘導体、好ましくは2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、2-ヒドロキシ-4-メトキシ-4'-メチルベンゾフェノンおよび2,2'-ジヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、

・ベンザルマロン酸エステル、好ましくは4-メトキシベンザルマロン酸ジ(2-エチルヘキシル)、
 ・2,4,6-トリアニリノ(p-カルボ-2'-エチル-1'-ヘキシルオキシ)-1,3,5-トリアジン、
 である。

有利な水溶性物質は：

・2-フェニルベンズイミダゾール-5-スルホン酸およびその塩、例えばナトリウム、カリウム、トリエタノールアンモニウム塩、
 ・ベンゾフェノンのスルホン酸誘導体、好ましくは2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン-5-スルホン酸およびその塩、
 ・例えば、4-(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル)ベンゼンスルホン酸、2-メチル-5-(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル)ベンゼンスルホン酸およびそれらの塩、のような3-ベンジリデンカンファールのスルホ

ン酸誘導体、
 である。

本発明により使用され得る挙げられるUVBフィルターの一覧はもちろん制限するものであることを意図されない。

本発明による製剤で、化粧用および／もしくは皮膚科用の製剤に通常含有されているUVAフィルターを採用することもまた有利でありうる。こうした物質は、好ましくは、ジベンゾイルメタン誘導体、とりわけ1-(4'-tert-ブチルフェニル)-3-(4'-メトキシフェニル)プロパン-1,3-ジオンおよび1-フェニル-3-(4'-イソプロピルフェニル)プロパン-1,3-ジオンである。本発明はまた、これらの組み合わせ剤を含む処方にも関する。UVBフィルター物質について挙げられたものと同じ量のUVAフィルター物質が使用され得る。

本発明による化粧用および／もしくは皮膚科用の製剤はまた、UV光線からの皮膚の保護のための化粧品で通常使用される無機色素も含み得る。これらはチタン、亜鉛、鉄、ジルコニウム、ケイ素、マンガン、アルミニウムおよびセリウムの酸化物ならびにそれらの混合物、ならびに酸化物が活性物質である修飾物であ

る。色素はとりわけ好ましくは二酸化チタンに基づくものである。上の組み合わせ剤について挙げられた量が使用され得る。

例えばUV光線からの皮膚の保護のためのものを包含する、本発明による化粧用および皮膚科用の製剤は、例えばこのタイプの製剤のため通常採用されるような多様な形態で存在し得る。それらはかように、例えば、溶液、油中水(W/O)型のもしくは水中油(O/W)型の乳剤、または例えば水中油中水(W/O/W)型の多重乳剤、ゲル、水分散液、

固形物のスティック状でなければエアゾルであり得る。

本発明による化粧用製剤は、そうした製剤で通常使用されるような化粧用補助物質、例えば保存剤、殺菌剤、抗酸化剤、香料、起泡を防止する作用物質、染料、着色作用を有する色素、濃厚化剤、界面活性物質、乳化剤、軟化物質、加湿物質および／もしくは湿潤物質、脂肪、油、蠟、または、アルコール、多価アルコール、ポリマー、泡安定化剤、電解質、有機溶媒もしくはシリコン誘導体のような化粧用製剤の他の通例の構成物を含み得る。

化粧用もしくは皮膚科用の製剤が溶液もしくはローションである場合、使用され得る溶媒は：

- ・水もしくは水性溶液、
- ・カプリン酸のもしくはカプリル酸のトリグリセリドのような油、しかし好ましくはヒマシ油、
- ・脂肪、蠟および他の天然に存在するおよび合成の脂肪物質、好ましくは脂肪酸の低炭素原子数のアルコールとの、例えばイソプロパノール、プロピレングリコールもしくはグリセロールとのエステル、または脂肪アルコールの低炭素原子数のアルカン酸とのもしくは脂肪酸とのエステル、
- ・低炭素原子数のアルコール、ジオールもしくは多価アルコールおよびそれらのエーテル、好ましくはエタノール、イソプロパノール、プロピレングリコール、グリセロール、エチレングリコール、エチレングリコールのモノエチルもしくはモノブチルエーテル、プロピレングリコールのモノメチル、モノエチルもしくはモノブチルエーテル、ジエチレングリコールのモノメチルもしくはモノエチルエ

ーテルならびに

類似の生成物、
である。

上述の溶媒の混合物がとりわけ使用される。水はアルコール性溶媒でさらなる構成物であり得る。

本発明により使用され得る有利な抗酸化剤は、化粧用および／もしくは皮膚科用の応用に適するもしくは通例である全ての抗酸化剤である。

抗酸化剤は、有利には、アミノ酸（例えばグリシン、ヒスチジン、チロシンおよびトリプトファン）ならびにそれらの誘導体、イミダゾール（例えばウロカン酸）およびそれらの誘導体、D, L-カルノシン、D-カルノシン、L-カルノシンのようなペプチドおよびそれらの誘導体（例えばアンセリン）、カロテノイド、カロテン（例えば α -カロテン、 β -カロテンおよびリコペン）ならびにそれらの誘導体、リポ酸およびその誘導体（例えばジヒドロリポ酸）、金チオグルコース、プロピルチオウラシルおよび他のチオール（例えばチオレドキシン、グルタチオン、システイン、シスチン、シスタミンならびにそれらのグリコシル、N-アセチル、メチル、エチル、プロピル、アミル、ブチルならびにラウリル、パルミトイル、オレイル、 γ -リノレイル、コレステリルおよびグリセリルエステル）ならびにそれらの塩、チオジプロピオン酸ジラウリル、チオジプロピオン酸ジステアリル、チオジプロピオン酸およびその誘導体（エステル、エーテル、ペプチド、脂質、ヌクレオチド、ヌクレオシドおよび塩）ならびに非常に低い耐えられる用量（例えば pmol ないし $\mu\text{mol/kg}$ ）のスルホキシイミン化合物（例えばブチオニンスルホキシイミン、ホモシステインスルホキシイミン、ブチオニンスルホン、ならびにペンター、ヘキサ-およびヘプターチオニンスルホキシイミン）、な

らびにさらに（金属）キレート剤（例えば α -ヒドロキシ脂肪酸、パルミチン酸、フィチン酸およびラクトフェリン）、 α -ヒドロキシ酸（例えばクエン酸、乳酸およびリンゴ酸）、フミン酸、胆汁酸、胆汁抽出物、ビリルビン、ビリベルジン、EDTA、EGTAおよびそれらの誘導体、不飽和脂肪酸およびそれらの誘

導体（例えば γ -リノレン酸、リノール酸およびオレイン酸）、葉酸およびその誘導体、ユビキノンおよびユビキノールならびにそれらの誘導体、ビタミンCおよび誘導体（例えばパルミチン酸アルコルビン酸、リン酸アスコルビン酸マグネシウムおよび酢酸アスコルビン酸）、トコフェロールおよび誘導体（例えば酢酸ビタミンE）、ビタミンAおよび誘導体（パルミチン酸ビタミンA）ならびにベンゾイン樹脂の安息香酸コニフェリル、ルチン酸およびその誘導体、フェルラ酸およびその誘導体、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、ノルジヒドログアヤク脂酸、ノルジヒドログアヤレチン酸、トリヒドロキシブチロフェノン、尿酸およびその誘導体、マンノースおよびその誘導体、亜鉛およびその誘導体（例えばZnOおよびZnSO₄）、セレンおよびその誘導体（例えばセレンメチオニン）、スチルベンおよびその誘導体（例えば酸化スチルベンおよび酸化trans-スチルベン）ならびに本発明により適する挙げられるこれらの有効成分の誘導体（塩、エステル、エーテル、糖、ヌクレオチド、ヌクレオシド、ペプチドおよび脂質）から成る群から選ばれる。

製剤中の抗酸化剤（1種もしくはそれ以上の化合物）の量は、好ましくは、当該製剤の総重量に基づき、0.001ないし30重量%、とりわけ好ましくは0.05~20重量%、とりわけ1~10重量%である。

ビタミンEおよび／もしくはその誘導体が抗酸化剤（1種もしくは複

数）である場合、その個々の濃度を、当該製剤の総重量に基づき、0.001~10重量%の範囲から選ぶのが有利である。

ビタミンAもしくはビタミンA誘導体またはカロテンもしくはそれらの誘導体が抗酸化剤（1種もしくは複数）である場合、その個々の濃度を、当該製剤の総重量に基づき、0.001~10重量%の範囲から選ぶのが有利である。

本発明による乳剤は有利であり、かつ、例えば脂肪、油、蠟および他の挙げられる脂肪物質、ならびに水およびそうしたタイプの乳剤で通常使用されるような乳化剤を含む。

本発明によるゲルは、通常、1種の濃厚化剤の存在下に、低炭素原子数のアルコール例えばエタノール、イソプロパノール、1,2-プロパンジオール、グリセ

ロール、および水、もしくは上述の油を含む。濃厚化剤は好ましくは油-アルコール性ゲルで二酸化ケイ素もしくはケイ酸アルミニウムであり、また、水-アルコール性もしくはアルコール性のゲルでは好ましくはポリアクリル酸エステルである。

本発明による固形物のスティックは、例えば天然に存在するもしくは合成の蠟、脂肪アルコールもしくは脂肪酸エステルを含む。リップケアスティックおよび脱臭するスティック（「デオスティック」）が好ましい。

エアゾル容器から噴射され得る、本発明による化粧用もしくは皮膚科用の製剤に適する噴射剤は、容易に揮発する液化された通例に知られる噴射剤、例えば炭化水素（プロパン、ブタン、イソブタン）である。これらは単独でもしくは相互との混合物として採用され得る。圧縮された空気もまた有利に使用され得る。

専門家はもちろん、それ自身非毒性でありかつ本発明に原則として適するがしかしにもかかわらず環境もしくは他の付随する状況に対する許容できない作用により削除されるべきである噴射剤ガス、とりわけフルオロ炭化水素およびクロロフルオロ炭化水素（CFC）が存在することを知っている。

本発明による製剤はさらに好ましくはUVB領域のUV輻射を吸収する物質を含み、フィルター物質の総量は、紫外輻射の全領域から皮膚を保護する化粧用製剤を提供するために、当該製剤の総重量に基づき、例えば0.1重量%ないし30重量%、好ましくは0.5ないし10重量%、とりわけ1ないし6重量%である。それらはまたサンスクリーン組成物としても使用され得る。

本発明による化粧用製剤はまた、UV光線からの皮膚の保護のための化粧品で通常使用される無機色素も含み得る。これらはチタン、亜鉛、鉄、ジルコニウム、ケイ素、マンガン、アルミニウムおよびセリウムの酸化物ならびにそれらの混合物、ならびに酸化物が活性物質である修飾物である。色素はとりわけ好ましくは二酸化チタンに基づくものである。

ヘアケアのための化粧用製剤は、例えばシャンプー組成物、シャンプーの前もしくは後、パーマメントウェーブ処理の前もしくは後、または髪の色もしくは脱色の前もしくは後に髪を洗い流す場合に使用される製剤、髪をドライヤーで乾

燥するもしくはセットするための製剤、着色もしくは脱色のための製剤、スタイリングおよびトリートメントのローション、ヘアリキッドもしくはパーマネントウェーブ組成物である。

化粧用製剤は、ヘアケアおよびヘアトリートメントのためのこのタイプ製剤で通常使用されるような有効成分および補助物質を含む。

使用される補助物質は、保存剤、界面活性物質、起泡を防止する物質、乳化剤、濃厚化剤、脂肪、油、蠟、有機溶媒、殺菌剤、香料、染料もしくは色素であり、それらの務めは髪もしくは製剤それ自身を着色することであり、電解質および製剤は髪が脂ぎったようになるのを防止する。

シャンプー組成物または洗浄用、シャワー用もしくは浴用の製剤である化粧用製剤は、好ましくは、最低1種の陰イオン性、非イオン性もしくは両性の界面活性物質またはそれらの混合物、水性溶媒中の本発明による最低1種のエトキシシル化されたもしくはプロポキシシル化された有機化合物およびこの目的のために通常使用されるような補助物質を含む。界面活性物質は、1重量%と50重量%との間の濃度で、シャンプー組成物または洗浄用、シャワー用もしくは浴用の製剤中に存在し得る。

化粧用もしくは皮膚科用の製剤が、洗い流されるかつ例えば脱色の前もしくは後、シャンプーの前もしくは後、2回のシャンプー段階の間またはパーマネントウェーブ処理の前もしくは後に使用されるローションの形態にある場合、それは、例えば、適切な場合には界面活性物質、好ましくは非イオン性もしくは陽イオン性の界面活性物質を含む水性もしくは水-アルコール性の溶液である。界面活性物質の濃度は、0.1と10重量%との間、好ましくは0.2と5重量%との間であり得る。この化粧用もしくは皮膚科用の製剤はまた、この目的のために通常使用される補助物質を含むエアゾルであり得る。

洗い流されないローション、とりわけ髪をセットするためのローション、髪をドライヤーで乾かすために使用されるローションもしくはスタイリングおよびトリートメントのローションの形態にある化粧用製剤は、一般に、水性、アルコール性もしくは水-アルコール性の溶液であり、

かつ、最低1種の陽イオン性、陰イオン性、非イオン性もしくは両性のポリマー、そうでなければそれらの混合物を含む。

髪の毛のトリートメントおよびケアのための化粧用および皮膚科用の製剤は、非イオン性もしくは陰イオン性のタイプの乳剤の形態にあり得る。非イオン性の乳剤は、水に加え、例えばポリエトキシ化もしくはポリプロポキシ化され得るか、または2種の有機成分の混合物でもまたあり得る油もしくは脂肪アルコールを含む。適切な場合は、これらの乳剤は陽イオン性の界面活性物質を含む。陰イオン性の乳剤は好ましくは石鹸のタイプのものであり、かつ、陰イオン性もしくは非イオン性の特徴を有する、本発明による最低1種のエトキシ化されたもしくはプロポキシ化された有機化合物を含む。

髪の毛のトリートメントおよびケアのための化粧用および皮膚科用の製剤は、本発明による最低1種のアルキル化されたヒドロキノンおよびこの目的のために通常使用される溶媒に加え、有機濃厚化剤、例えばアラビアゴム、キサントガム、アルギン酸ナトリウム、セルロース誘導体、好ましくはメチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロースもしくはヒドロキシプロピルメチルセルロース、または無機濃厚化剤、例えば、例えばベントナイトのようなケイ酸アルミニウム、またはポリエチレングリコールおよびステアリン酸ポリエチレングリコールもしくはジステアリン酸ポリエチレングリコールの混合物もまた含むゲルの形態にあり得る。このゲルは、濃厚化剤を例えば0.1と30重量%との間、好ましくは0.5と15重量%との間の量で含む。

別に述べられない限り、量のデータ、パーセントのデータおよび割合

(parts)は重量、とりわけ特定の混合物もしくは製剤の総重量に関する。

本発明はまた、製剤、とりわけ挙げられる障害もしくは疾患の治療のための製薬学的製剤の調製のための本発明による有効成分の使用にも関する。

以下の実施例は本発明の態様を例証することを意図される。

ための製薬学的製剤の調製のための本発明による有効成分の使用にも関する。

以下の実施例は本発明の態様を例証することを意図される。

実施例 1

W/Oクリーム	I	II	III
パラフィン油	10.00	10.00	10.00
オゾケライト	4.00	4.00	4.00
ワセリン	4.00	4.00	4.00
植物油	10.00	10.00	10.00
羊毛脂アルコール	2.00	2.00	2.00
ステアリン酸アルミニウム	0.40	0.40	0.40
セテアリルグルコシド	1.0	-	-
デシルグルコシド	-	1.0	-
カプリリル/カプリルグルコシド	-	-	1.0
香料、保存料	適量		
完全に脱塩された水	100.00に		

実施例 2

W/Oローション	I	II	III
パラフィン油	25.00	25.00	25.00

シリコーン油	2.00	2.00	2.00
セレシン	1.50	1.50	1.50
羊毛脂アルコール	0.50	0.50	0.50
セスキイソステアリン酸グルコース	2.50	2.50	2.50
セテアリルグルコシド	1.0	-	-
デシルグルコシド	-	1.0	-
カプリリル/カプリルグルコシド	-	-	1.0
香料、保存料	適量		
完全に脱塩された水	100.00に		

実施例 3

O/Wローション	I	II	III
パラフィン油	5.00	5.00	5.00
パルミチン酸イソプロピル	5.00	5.00	5.00
セチルアルコール	2.00	2.00	2.00
ミツロウ	2.00	2.00	2.00
セテアレス-20	2.00	2.00	2.00
PEG 20-ステアリン酸グリセリル	1.50	1.50	1.50
グリセロール	3.00	3.00	3.00
キサントラン	1.00	-	-
イヌリン	-	1.0	-
キシラン	-	-	1.0
香料、保存料	適量		
完全に脱塩された水	100.00に		

実施例 4

O/Wクリーム	I	II	III
植物油	10.00	10.00	10.00
セチルアルコール	2.00	2.00	2.00
モノステアリン酸グリセロール	1.50	1.50	1.50
PEG 30-ステアリン酸グリセリル	2.00	2.00	2.00
グリセロール	3.00	3.00	3.00
パルミチン酸イソプロピル	5.00	5.00	5.00
カルボポール 980 (中和された)	0.30	0.30	0.30
キサンタン	1.00	-	-
イヌリン	-	1.0	-
キシラン	-	-	1.0
香料、保存料	適量		
完全に脱塩された水	100.00に		

実施例5

軟膏	I	II	III
ワセリン	36.00	36.00	36.00
セレシン	10.00	10.00	10.00
酸化亜鉛	4.00	4.00	4.00
植物油	20.00	20.00	20.00
セラミド II	0.02	-	-
セラミド VI	-	0.02	-
フィトスピンゴシン	-	-	0.02
香料、保存料	適量		
パラフィン油	100.00に		

実施例6

	I	II	III
スキンオイル			
パルミチン酸セチル	3.00	3.00	3.00
安息香酸C12-15アルキル	2.00	2.00	2.00
ポリイソブテン	10.00	10.00	10.00
スクアラン	2.00	2.00	2.00
セテアリルグルコシド	0.5	-	-
カプリリル/カプリルグルコシド	-	0.5	-
デシルグルコシド	-	-	0.5
香料、保存料		適量	
パラフィン油		100.00に	

実施例7

	I	II	III
バスオイル			
パラフィン油	20.00	20.00	20.00
P E G 40-水素化ヒマシ油	5.00	5.00	5.00
セテアリルグルコシド	0.5	-	-
カプリリル/カプリルグルコシド	-	0.5	-
デシルグルコシド	-	-	0.5
香料、保存料		適量	
ダイズ油		100.00に	

実施例8

	I	II	III
口紅			
セレシン	8.00	8.00	8.00
ミツロウ	4.00	4.00	4.00

カルナウバロウ	2.00	2.00	2.00
ワセリン	40.00	40.00	40.00
水素化ヒマシ油	4.00	4.00	4.00
カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	6.00	6.00	6.00
フコース	0.02	-	0.02
ガラクトース	-	0.02	0.02
マルトース	0.02	0.02	0.02
香料、保存料		適量	
パラフィン油		100.00に	

実施例9

ケア用バック	I	II	III
PEG 50-ラノリン	0.50	0.50	0.50
ステアリン酸グリセリル	2.00	2.00	2.00
ヒマワリ種子油	3.00	3.00	3.00
ベントナイト	8.00	8.00	8.00
カオリン	35.00	35.00	35.00
酸化亜鉛	5.00	5.00	5.00
アルギン酸	1.00	-	-
ガラクトン	-	1.00	-
ヒアルロン酸	-	-	1.00
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

実施例10

リポソーム含有ゲル	I	II	III
-----------	---	----	-----

レシチン	6.00	6.00	6.00
植物油	12.50	12.50	12.50
加水分解コラーゲン	2.00	2.00	2.00
キサントガム	1.40	1.40	1.40
ブチレングリコール	3.00	3.00	3.00
フコース	0.3	-	-
ラフィノース	0.3	-	-
ガラクトース	0.3	-	-
マンノース	-	0.3	-
ラムノース	-	0.3	-
フコース	-	0.3	-
マンノース	-	-	0.3
ラフィノース	-	-	0.3
ガラクトース	-	-	0.3
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

実施例 11

再潤滑剤(re-oiling agent)を含むシャワー調製物

	I	II	III
アミド二酢酸ココナツ	10.00	10.00	10.00
ラウリル硫酸ナトリウム	25.00	25.00	25.00
コシル加水分解コラーゲンカリウム	5.00	5.00	5.00
マカダミアナツ油	5.00	5.00	5.00
塩化ナトリウム	0.60	0.60	0.60

(41)

特表平10-513165

フコース	0.3	
ラフィノース	0.3	
ガラクトース	0.3	
マンノース		0.3
ラムノース		0.3
フコース		0.3
マンノース		0.3
ラフィノース		0.3
ガラクトース		0.3
香料、保存料		適量
完全に脱塩された水		100.00に

実施例12

棒石鹼	I	II	III
獣脂脂肪酸からのナトリウム塩	60.00	60.00	60.00
ココナツ油からのナトリウム塩	28.00	28.00	28.00
塩化ナトリウム	0.50	0.50	0.50
カプリリル/カプリルグルコシド	1.0	-	-
セテアリルグルコシド	-	1.00	-
デシルグルコシド	-	-	1.00
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

実施例13

合成洗剤	I	II	III
ラウリル硫酸ナトリウム	30.00	30.00	30.00

スルホコハク酸ナトリウム	10.00	10.00	10.00
ココイル加水分解コラーゲンカリウム	2.00	2.00	2.00
ジメチコンコポリオール	2.00	2.00	2.00
パラフィン	2.00	2.00	2.00
トウモロコシデンプン	10.00	10.00	10.00
タルク	10.00	10.00	10.00
グリセロール	3.00	3.00	3.00
カプリリル/カプリルグルコシド	1.0	-	-
セテアリルグルコシド	-	1.00	-
デシルグルコシド	-	-	1.00
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

実施例 14

ヘアケア組成物	I	II	III
ココイル加水分解コラーゲンTEA	30.00	30.00	30.00
ラウリル硫酸モノエタノールアミン	25.00	25.00	25.00
アーモンド油	2.00	2.00	2.00
塩化ナトリウム	1.00	1.00	1.00
スフィンゴシン	1.0	-	-
セラミド II	-	1.00	-
セラミド IV	-	-	1.00
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

実施例 15

	I	II	III
ケアシャンプー			
ラウリル硫酸ナトリウム	34.00	34.00	34.00
ラウリルスルホコハク酸二ナトリウム	6.00	6.00	6.00
ココアミドプロピルベタイン	10.00	10.00	10.00
ジステアリン酸グリコール	5.00	5.00	5.00
スフィンゴシン	0.02	-	-
セラミド II	-	1.00	-
セラミド IV	-	-	1.00
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

実施例 16

	I	II	III
ヘアトリートメント			
セチルアルコール	5.00	5.00	5.00
カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	3.00	3.00	3.00
ペトロラタム	2.00	2.00	2.00
羊毛脂アルコール	0.50	0.50	0.50
スフィンゴシン	1.0	-	-
セラミド II	-	1.00	-
セラミド IV	-	-	1.00
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

実施例 17

	I	II	III
ヘアリンス			
ココアミドプロピルベタイン	5.00	5.00	5.00

(44)

特表平10-513165

セチルアルコール	2.00	2.00	2.00
プロピレングリコール	2.00	2.00	2.00
クエン酸	0.30	0.30	0.30
スフィンゴシン	1.0	-	-
セラミド II	-	1.00	-
セラミド IV	-	-	1.00
香料、保存料	適量		
完全に脱塩された水	100.00に		

実施例 18

ヘアセット組成物	I	II	III
ポリビニルピロリドン／酢酸ビニル／			
プロピオン酸ビニルコポリマー	5.00	5.00	5.00
エタノール	45.00	45.00	45.00
スフィンゴシン	1.0	-	-
セラミド II	-	1.00	-
セラミド IV	-	-	1.00
香料、保存料	適量		
完全に脱塩された水	100.00に		

実施例 19

スタイリングクリーム	I	II	III
ワセリン	4.00	4.00	4.00
セテアリルアルコール	4.00	4.00	4.00
P E G 40-水素化ヒマシ油	2.00	2.00	2.00
パルミチン酸イソプロピル	5.00	5.00	5.00

(45)

特表平10-513165

クエン酸	1.00	1.00	1.00
グルコース6-リン酸	0.3		
マンノース6-リン酸	0.3		
マンノース	0.3		
ラフィノース		0.3	
N-アセチルグルコサミン		0.3	
フコース		0.3	
ガラクトース			0.3
N-アセチルグルコサミン			0.3
フコース			0.3
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

実施例20

シェービングフォーム	I	II	III
ステアリン酸	7.00	7.00	7.00
ラウリル硫酸ナトリウム	3.00	3.00	3.00
ステアリルアルコール	1.00	3.00	3.00
グリセロール	5.00	5.00	5.00
トリエタノールアミン	3.60	3.60	3.60
グルコース6-リン酸	0.3		
マンノース6-リン酸	0.3		
マンノース	0.3		
ラフィノース		0.3	
N-アセチルグルコサミン		0.3	

フコース	0.3
ガラクトース	0.3
N-アセチルグルコサミン	0.3
フコース	0.3
香料、保存料	適量
完全に脱塩された水	100.00に

実施例 2 1

フットクリーム	I	II	III
ソルアン 5	2.00	2.00	2.00
サリチル酸メチル	5.00	5.00	5.00
カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	10.00	10.00	10.00
ステアリン酸	5.00	5.00	5.00
セチルアルコール	1.00	1.00	1.00
グリセロール	2.00	2.00	2.00
ジメチコン	1.00	1.00	1.00
カルボポール 984	0.50	0.50	0.50
トリエタノールアミン	1.50	1.50	1.50
アミロース	1.0	-	-
グリコーゲン		1.0	
デキストラン	-	-	1.00
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

実施例 2 2

エアゾルスプレー	I	II	III
----------	---	----	-----

オクチルドデカノール	0.50	0.50	0.50
リボシルアミン	0.02	-	-
N-アセチルグルコサミン	-	0.02	-
N-ガラクトサミン	-	-	0.02
香料、保存料	適量		
エタノール	100.00に		

特定の構成物を一緒に混合することにより得られる液相を、プロパン-ブタン混合物（2：7）と一緒に39：61の比でエアゾル容器に移す。

実施例 2 3

ポンプスプレー	I	II	III
P E G 40-水素化ヒマシ油	2.00	2.00	2.00
グリセロール	1.00	1.00	1.00
リボシルアミン	0.02	-	-
N-アセチルグルコサミン	-	0.02	-
N-ガラクトサミン	-	-	0.02
香料、保存料	適量		
完全に脱塩された水	100.00に		

実施例 2 4

ロールオンゲル	I	II	III
1,3-ブチレングリコール	2.00	2.00	2.00
P E G 40-水素化ヒマシ油	2.00	2.00	2.00
ヒドロキシエチルセルロース	0.50	0.50	0.50
グルコース6-リン酸	0.3		
マンノース6-リン酸	0.3		

マンノース	0.3	
マンノース		0.3
ラムノース		0.3
フコース		0.3
マンノース		0.3
ラフィノース		0.3
ガラクトース		0.3
香料、保存料		適量
完全に脱塩された水		100.00に

実施例25

ロールオン乳剤	I	II	III
リン酸トリセテアレス	0.30	0.30	0.30
オクチルドデカノール	2.00	2.00	2.00
安息香酸C12-15アルキル	2.00	2.00	2.00
安息香酸C10-30アシル	0.15	0.15	0.15
グルコース6-リン酸	0.3		
マンノース6-リン酸	0.3		
マンノース	0.3		
マンノース		0.3	
ラムノース		0.3	
フコース		0.3	
マンノース			0.3
ラフィノース			0.3
ガラクトース			0.3

香料、保存料

適量

完全に脱塩された水

100.00に

実施例 2 6

蠟スティック	I	II	III
水素化ヒマシ油	5.00	5.00	5.00
ミツロウ	6.00	6.00	6.00
セレシン	30.00	30.00	30.00
安息香酸 C 12-15アルキル	17.00	17.00	17.00
アミロペクチン	0.5		
キトサン		0.5	
セルロース			0.5
香料、保存料			適量
オクチルドデカノール			100.00に

実施例 2 7

カプセル剤の調製

1. 下に示される構成物を含むカプセル剤が既知の方法により調製される。これらは、各場合に1カプセルを1日1回もしくは数回の投薬量で上の目的の治療に適する：

イヌリン	0.5g
ヒドロキシエチルセルロース	0.5g

上の実施例の数的データは重量%である。

実施例 2 8

エアゾルスプレー	I	II	III
オクチルドデカノール	0.50	0.50	0.50

オラミックス NS 10	2.0	
プラントレン 1200		2.0
プラントレン 2000		2.0
香料、保存料		適量
エタノール		100.00に

特定の構成物を一緒に混合することにより得られる液相を、プロパン-ブタン混合物（2：7）と一緒に39：61の比でエアゾル容器に移す。

実施例 29

ポンプスプレー	I	II	III
P E G 40-水素化ヒマシ油	2.00	2.00	2.00
グリセロール	1.00	1.00	1.00
オラミックス NS 10	2.0	-	-
プラントレン 1200	-	2.0	-
プラントレン 2000	-	-	2.0
香料、保存料		適量	
完全に脱塩された水		100.00に	

本実施例の数的データは重量%である。

本発明による有効成分はとりわけ有利に微小乳剤で使用され得る。本発明による化粧用および皮膚科用の製剤は、とりわけ有利に、

- a) 濃厚化されない、
- b) 例えば、ポリオキサマー、プルロニックス、カラゲナンもしくは植物ガムの添加により慣習的に濃厚化される、
- c) A-B-Aの3ブロックコポリマー（例えばジステアリン酸P E G 150、アクゾ ノーベル (Akzo Nobel)）または α 、 ω -ビス-ポリエトキ

シル化シランもしくはシリコーンの添加により濃厚化される、

- d) スターポリマー（例えばP E G 300-テトラステアリン酸ペンタエリトリチ

ルまたは疎水性に修飾されたテトラキスポリエトキシ化シランおよびシリコーン)の添加により濃厚化される、

e) A-B-A-B多ブロックコポリマー、スターバーストポリマー、デンドリマーおよび他の超分子架橋剤(例えばレオドール(Rheodol)TWIS 399、KAOもしくはPEG 120-ジオレイン酸メチルグルコース)の添加により濃厚化される、

水中油(O/W)、複継続的(bicontinuous)もしくは油中水(W/O)微小乳剤として使用され得る。

実施例30

1,3-ジ(2-エチルヘキシル)シクロヘキサン	35
プラントレン 1200	10
モノラウリン酸ソルビタン	10
水(pH5.5までクエン酸を加える)	45

実施例31

1,3-ジ(2-エチルヘキシル)シクロヘキサン	33
プラントレン 1200	10
モノラウリン酸ソルビタン	10
水(pH5.5までクエン酸を加える)	45
ジステアリン酸PEG 150	2

実施例32

ステアレス-15	4.8
モノステアリン酸グリセロール	2.4

プラントレン 1200	2.5
シクロメチコン	3.3
オクタノン酸セテアリル	1.7
水	85.3

実施例33

ステアレス-15	4.8
----------	-----

モノステアリン酸グリセロール	2.4
プラントレン 1200	2.5
シクロメチコン	3.3
オクタノン酸セテアリル	1.7
水	83.3
ジステアリン酸PEG 150	2.0

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PC./EP 96/00441

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
IPC 6	A01N43/16 A61K7/48	A01N43/08 A01N31/02 A61K7/06 A61K7/32
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
IPC 6 A01N A61K		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP,A,0 380 084 (BIOMEMBRANE INST) 1 August 1990 see claims see page 4, line 46 - line 49 see page 8, line 29 - line 41 see page 9, line 22 - line 28 ---	1-7
X	WO,A,86 03937 (CHEMICAL DYNAMICS SWEDEN AB) 17 July 1986 see claims ---	1-7
X	US,A,5 002 759 (A. GAFFAR ET AL.) 26 March 1991 see column 1, line 36 - line 46 see column 3, line 13 - line 22 ---	1-7
-/-		
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents:		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "Z" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
22 January 1997		04.02.97
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl. Fax (+31-70) 340-3016		Authorized officer Decorte, D

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PC./EP 96/00441

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	WO,A,95 17898 (NOVADEX PHARMACEUTICALS LIMITE ;UNIV BRITISH COLUMBIA (CA)) 6 July 1995 see claim 31 ---	1-7
P,X	WO,A,95 15149 (SEDERMA S A ;GREFF DANIEL (FR)) 8 June 1995 see claims see page 2, line 3 - line 7 ---	1-7
P,X	WO,A,95 07084 (LAEVOSAN GMBH & CO KG ;GUGGENBICHLER JOSEF PETER (DE); MEISSNER PE) 16 March 1995 see page 1, paragraph 3 - paragraph 4 see page 2, paragraph 1 ---	1-7
X	WO,A,93 14773 (SOEREMARK RUNE) 5 August 1993 see claim 1 see page 1, line 21 - page 2, line 2 ---	1-7
X	WO,A,93 00067 (BIOEUROPE) 7 January 1993 see claims 1,8 see page 1 ---	3-7
X	FR,A,2 609 397 (LABORATOIRES SEROBIOLOGIQUES) 15 July 1988 see claims see page 3, line 25 - line 29 ---	3-7
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 018, no. 562 (C-1265), 27 October 1994 & JP,A,06 200412 (MITSUBISHI RAYON CO LTD), 19 July 1994, see abstract -----	3-7

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.

PL, EP 96/08441

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP-A-0380084	01-08-90	CA-A- 2008519 JP-A- 2275826	24-07-91 09-11-90
WO-A-8603937	17-07-86	AU-B- 598187 AU-A- 5314886 CA-A- 1270768 EP-A- 0207978 JP-T- 62501362 SE-A- 8500102 US-A- 4859656	21-06-90 29-07-86 26-06-90 14-01-87 04-06-87 11-07-86 22-08-89
US-A-5002759	26-03-91	US-A- 5095106	10-03-92
WO-A-9517098	06-07-95	US-A- 5514665 AU-A- 1377995 EP-A- 0737072	07-05-96 17-07-95 16-10-96
WO-A-9515149	08-06-95	FR-A- 2713086 AU-A- 7188594	09-06-95 19-06-95
WO-A-9507084	16-03-95	DE-A- 4330773 AU-A- 7695694 EP-A- 0716605 PL-A- 313393	16-03-95 27-03-95 19-06-96 24-06-96
WO-A-9314773	05-08-93	AU-A- 3465393 SE-A- 9200199	01-09-93 25-07-93
WO-A-9300067	07-01-93	FR-A- 2678166 AU-A- 2243492 CA-A- 2112237 DE-D- 69214815 EP-A- 0591443 JP-T- 6508832 US-A- 5518733	31-12-92 25-01-93 07-01-93 28-11-96 13-04-94 06-10-94 21-05-96
FR-A-2609397	15-07-88	NONE	

フロントページの続き

(51)Int.Cl. ⁶	識別記号	F I
C 0 7 H	3/02	C 0 7 H 3/02
	3/04	3/04
	5/04	5/04
	11/04	11/04
	15/02	15/02
(72)発明者	ボルフ、フロリアン	
	ドイツ連邦共和国デー20251ハンブル	
	ク・フズマーシュトラッセ2	